

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/011645

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 7 A61K31/55 C07D405/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, EMBASE

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/045977 A (TRUSTEES OF TUFTS COLLEGE; BACHOVCHIN, WILLIAM, W) 5 June 2003 (2003-06-05)	1,29-76
A	the whole document	2
A	----- WO 03/035067 A (FERRING B.V.; EVANS, DAVID, MICHAEL; TARTAR, ANDRE) 1 May 2003 (2003-05-01)	1,2, 29-76
	the whole document	
P,X	----- WO 2004/041820 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG; HIMMELSBACH, FRANK; LANGKOP) 21 May 2004 (2004-05-21)	1,29-76
P,A	the whole document	2
	-----	

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 March 2005

Date of mailing of the international search report

28.04.05.

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Von Daacke, A

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
  
Although claims 31 to 45 and 61 to 76 relate to a method for treatment of the human or animal body, the search was carried out on the basis of the alleged effects of the compound or composition.
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

**See the supplemental sheet.**

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:  
**1, 2 (in part), 29-76 (in part)**

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
EP2004/011645

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1, 2 (in part), 29-76 (in part)

compounds of formula D1 (a) and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim 2, compound D1.003 and claims 29-76).

---

2. Claims 1, 2 (in part), 29-76 (in part)

compounds of formula D1 (b) and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim 2, compound D1.001 and claims 29-76).

---

3. Claims 1, 2 (in part), 29-76 (in part)

compounds of formula D1.002 and corresponding parts in the related claims 29-76.

---

4. Claims 1, 2 (in part), 29-76 (in part)

compounds of formula D1.004 and corresponding parts in the related claims 29-76.

---

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
EP2004/011645

## 5. Claims 3, 4 and parts of claims 29-76

compounds of formula D2 and corresponding parts in the  
related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 6. Claims 5, 6 and parts of claims 29-76

compounds of formula D3 and corresponding parts in the  
related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 7. Claims 7, 8 and parts of claims 29-76

compounds of formula D4 and corresponding parts in the  
related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 8. Claims 9, 10 and parts of claims 29-76

compounds of formula D5 and corresponding parts in the  
related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 9. Claims 11, 12 and parts of claims 29-76

compounds of formula D6 and corresponding parts in the  
related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 10. Claims 13, 14 and parts of claims 29-76

compounds of formula D7 (a), (b) and (c) and corresponding  
parts in the related claims (succedent dependent claim and  
claims 29-76).

---

## 11. Claims 15, 16 and parts of claims 29-76

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
EP2004/011645

compounds of formula D8 and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 12. Claims: parts of claims 17, 18 and 29-76

compounds of formula D9 (a), (b) and (c) wherein Z is sulfur and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 13. Claims 17, 18 and 29-76

compounds of formula D9 (a), (b) and (c) wherein Z is phosphorus and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 14. Claims 19, 20 and parts of claims 29-76

compounds of formula D10 and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 15. Claims 21, 22 and parts of claims 29-76

compounds of formula D11 and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 16. Claims 23, 24 and parts of claims 29-76

compounds of formula D12 and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

---

## 17. Claims 25, 26 and parts of claims 29-76

compounds of formula D13 and corresponding parts in the related claims (succedent dependent claim and claims 29-76).

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP2004/011645

## 18. Claims 27, 28 and parts of claims 29-76

compounds of formula D14 (a), (b) and (c) and corresponding parts in the related claims (succeedent dependent claim and claims 29-76).

---

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/011645

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03045977	A	05-06-2003	AU 2002357767 A1	10-06-2003
			CA 2468192 A1	05-06-2003
			EP 1469873 A2	27-10-2004
			WO 03045977 A2	05-06-2003
			US 2005070482 A1	31-03-2005
-----				
WO 03035067	A	01-05-2003	CA 2464256 A1	01-05-2003
			EP 1450794 A1	01-09-2004
			WO 03035067 A1	01-05-2003
			NZ 532044 A	24-03-2005
			US 2005004205 A1	06-01-2005
-----				
WO 2004041820	A	21-05-2004	DE 10251927 A1	19-05-2004
			AU 2003293649 A1	07-06-2004
			WO 2004041820 A1	21-05-2004
			US 2004138214 A1	15-07-2004
-----				

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/011645

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 A61K31/55 C07D405/12

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, EMBASE

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/045977 A (TRUSTEES OF TUFTS COLLEGE; BACHOVCHIN, WILLIAM, W) 5. Juni 2003 (2003-06-05)	1,29-76
A	das ganze Dokument	2
A	WO 03/035067 A (FERRING B.V; EVANS, DAVID, MICHAEL; TARTAR, ANDRE) 1. Mai 2003 (2003-05-01)	1,2, 29-76
	das ganze Dokument	
P,X	WO 2004/041820 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG; HIMMELSBACH, FRANK; LANGKOP) 21. Mai 2004 (2004-05-21)	1,29-76
P,A	das ganze Dokument	2

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

11. März 2005

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

28.04.05

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Von Daacke, A



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/011645

## Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☒ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich  
Obwohl die Ansprüche 31 - 45 und 61 - 76 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung/Zusammensetzung.
2. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☒ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:  
1, 2 (Teil), 29-76 (Teil)

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2004/ 011645

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1, 2(Teil),29-76 (Teil)

Verbindungen der Formel D1 (a) und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch 2, Verbindung D1.003 und Ansprüche 29-76).

---

2. Ansprüche: Ansprüche 1,2(Teil),29-76(Teil)

Verbindungen der Formel D1 (b) und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch 2, Verbindung D1.001 und Ansprüche 29-76).

---

3. Ansprüche: Ansprüche 1,2(Teil),29-76(Teil)

Verbindung der Formel D1.002 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen 29-76.

---

4. Ansprüche: Ansprüche 1,2(Teil),29-76(Teil)

Verbindung der Formel D1.004 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen 29-76.

---

5. Ansprüche: Ansprüche 3,4 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D2 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

6. Ansprüche: Ansprüche 5,6 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formeln D3 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

7. Ansprüche: Ansprüche 7,8 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D4 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

8. Ansprüche: Ansprüche 9,10 und Teile der Ansprüche 29-76

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2004/ 011645

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Verbindungen der Formel D5 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

9. Ansprüche: Ansprüche 11,12 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D6 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

10. Ansprüche: Ansprüche 13,14 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formeln D7 (a), (b) und (c) und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

11. Ansprüche: Ansprüche 15,16 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D8 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

12. Ansprüche: Teile der Ansprüche 17,18 und 29-76

Verbindungen der Formeln D9 (a), (b) und (c) worin Z Schwefel bedeutet und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

13. Ansprüche: Ansprüche 17,18 und 29-76

Verbindungen der Formeln D9 (a), (b) und (c), worin Z Phosphor bedeutet und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

14. Ansprüche: Ansprüche 19,20 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D10 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

15. Ansprüche: Ansprüche 21,22 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D11 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2004/ 011645

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

16. Ansprüche: Ansprüche 23,24 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D12 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

17. Ansprüche: Ansprüche 25,26 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formel D13 und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

18. Ansprüche: Ansprüche 27,28 und Teile der Ansprüche 29-76

Verbindungen der Formeln D14 (a), (b) und (c) und zugehörige Teile in den damit zusammenhängenden Ansprüchen (nachfolgender Unteranspruch und Ansprüche 29-76).

---

BEST AVAILABLE COPY

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/011645

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03045977 A	05-06-2003	AU 2002357767 A1	10-06-2003
		CA 2468192 A1	05-06-2003
		EP 1469873 A2	27-10-2004
		WO 03045977 A2	05-06-2003
		US 2005070482 A1	31-03-2005
-----	-----	-----	-----
WO 03035067 A	01-05-2003	CA 2464256 A1	01-05-2003
		EP 1450794 A1	01-09-2004
		WO 03035067 A1	01-05-2003
		NZ 532044 A	24-03-2005
		US 2005004205 A1	06-01-2005
-----	-----	-----	-----
WO 2004041820 A	21-05-2004	DE 10251927 A1	19-05-2004
		AU 2003293649 A1	07-06-2004
		WO 2004041820 A1	21-05-2004
		US 2004138214 A1	15-07-2004
-----	-----	-----	-----